PRODUCTOS FARMACÉUTICOS
NORGREEN S.A.

LIDOCAÍNA CLORHIDRATO 1 % Y 2 % - NORGREEN
LIDOCAÍNA CLORHIDRATO 1 % Y 2 % con EPINEFRINA – NORGREEN

Inyectable
Venta Bajo Receta
Uso profesional exclusivo Industria Argentina

No contiene conservadores – Descartar cualquier remanente.

Fórmula cuali – cuantitativa – LIDOCAÍNA CLORHIDRATO 1 y 2 %
Cada 100 ml de solución inyectable contienen:

	1 %	2 %
Lidocaína clorhidrato	1,000 g	2,000 g
Cloruro de sodio	0,600 g	0,600 g
Agua para inyectables c.s.p.	100 ml	100 ml

Fórmula cuali – cuantitativa – LIDOCAÍNA CLORHIDRATO 1 y 2 % CON EPINEFRINA
Cada 100 ml de solución inyectable contienen:

	1%	2%
Lidocaína clorhidrato	1,000 g	2,000 g
Epinefrina (como bitartrato)	0,500 mg	0,500 mg
Cloruro de sodio	0,600 g	0,600 g
Acido cítrico anhidro	0,020 g	0,020 g
Metabisulfito de sodio	0,050 g	0,050 g
Agua para inyectables c.s.p.	100 ml	100 ml

Acción terapéutica
Anestésico local de acción moderadamente prolongada sin y con vasoconstrictor

Propiedades y efectos:
La lidocaína es un anestésico local de tipo amida. Es 4 veces más activo y su duración 2 veces más elevada, pero solamente 2 veces más tóxica que la procaína (de tipo éster). La duración de latencia separando la administración inicial de los efectos del producto es de 1 a 2 minutos en anestesia de superficie y de 3 a 4 minutos en anestesia de conducción y en anestesia por infiltración.
El agregado de epinefrina, un vaso constrictor frena la desaparición de la lidocaína del sitio de inyección, si bien el inicio de los efectos del producto son de 1 a 2 minutos en anestesia de superficie y de 3 a 4 minutos en anestesia de conducción y en anestesia por infiltración.
El agregado de epinefrina, un vaso constrictor frena la desaparición de la lidocaína del sitio de inyección, si bien el inicio de los efectos son aún más rápidos y la acción del producto es más prolongada, Lidocaína con epinefrina puede ser utilizada a una posología dos veces y media más elevada que la lidocaína.
La lidocaína presenta además propiedades antiarrítmicas, particularmente interesantes dentro de los desórdenes del ritmo ventricular, por ejemplo en la intervención de cirugía cardíaca o los de un infarto de miocardio.

Farmacocinética:

Epinefrina:
Absorción:
Los efectos de la epinefrina se producen rápidamente después de una inyección local. La vasoconstricción local disminuye y prolonga la absorción de la lidocaína. La toxicidad sistémica de la lidocaína puede así ser reducida.
Distribución:
La epinefrina atraviesa muy poco la barrera hematoencefálica, a las dosis terapéuticas.
La epinefrina atraviesa la barrera placentaria, y pasa a la leche materna.
Metabolismo/eliminación:
La epinefrina circulante es metabolizada en el hígado y dentro de otros tejidos por las enzimas catecol – O – metiltransferasa (COMT) y la monoamino-oxidasa (MAO). Los metabolitos principales inactivos son la metanefrina y el ácido 3 metoxi – 4 – hidroximandélico (ácido vanililmandélico, VMA).
Aproximadamente 40 % de una dosis parenteral de epinefrina es eliminada por vía renal en forma de metanefrina, 40 % en forma de VMA, 7 % en forma de 3 metoxi 4 hidroxi fenolglicol, 2 % en forma de ácido 3,4 dihidroximandélico y la fracción restante en forma de gluco-conjugados. Sólo una fracción menor es excretada por vía renal y en forma intacta.

Lidocaína
Absorción:
Después de una inyección local, la lidocaína difunde rápidamente en los tejidos circundantes. La vida media plasmática es de 10 minutos después de la inyección intravenosa.
Distribución:
La extensión de la unión a proteínas plasmáticas es variable y depende de las concentraciones sericas de lidocaína. La lidocaína se distribuye rápidamente dentro del corazón, del cerebro, los riñones y otros tejidos. Se produce posteriormente una acumulación dentro del tejido muscular y dentro del tejido graso. La lidocaína atraviesa rápidamente la barrera hemato encefálica y la barrera placentaria. Se la encuentra en la leche materna.

Metabolismo/eliminación:
La degradación hepática da lugar a diferentes metabolitos débilmente activos, eliminados por vía renal. Entre otros monoetilxilidida de glicina.
Se observa luego un clivaje del grupo amida debido a las xilidinas y las 4 – hidroxilidinas.
Menos del 10 % de una dosis son excretados por vía renal en forma incambiable.

Indicaciones y posibilidades de empleo:
Anestesia de superficie y de conducción y anestesia por infiltración en intervenciones quir{urgicas, obstétricas y dentales.

Posología/ modo de empleo
Lidocaína
Adultos y niños: posología máxima de 4,5 mg / Kg / peso (=300 mg)

Lidocaína – Epinefrina:
Adultos y niños: posología máxima 7mg / Kg / peso (= 500 mg)

Anestesia raquídea: posología máxima hasta 100 mg
Estas posologías corresponden a los volúmenes siguientes:

Lidocaína	Posología máxima	Lidocaína – Epinefrina	Posología máxima
1 %	30 ml	1 %	50 ml
2 %	15 ml	2 %	25 ml

Niños: En función de la edad, administrar una posología menor y elegir la solución más diluida (1 %).

Las inyecciones deben aplicarse siempre lentamente con aspiración frecuente para evitar una inyección intravascular rápida accidental que puede provocar efectos tóxicos.
Para anestesia epidural debe administrarse una dosis de prueba de 3 – 5 ml de lidocaína con epinefrina ya que una inyección intravascular de epinefrina puede reconocerse por un aumento de corta duración de la frecuencia cardíaca. Debe mantenerse el contacto verbal y el control repetido de la frecuencia cardíaca dentro de un período de cinco minutos después de la dosis de prueba.
Repetir la aspiración antes de administrar la dosis total. La dosis principal debe inyectarse lentamente 25 – 30 mg/min e ir incrementándola con monitoreo constante del paciente.
Si se producen síntomas tóxicos leves, la inyección debe interrumpirse de inmediato.
Suministrar la dosis más baja que produce el efecto deseado. Las dosis deben disminuirse en niños o ancianos o en pacientes debilitados o con deficiencia cardíaca y/o hepática.
Las dos tablas siguientes resumen volúmenes y concentraciones recomendadas de inyección de Lidocaína clorhidrato 1 y 2 % (tabla 1) y Lidocaína clorhidrato 1 y 2 % con epinefrina (tabla 2), para diversos tipos de procedimientos anestésicos. Las dosis recomendadas intentan servir sólo como guía para la cantidad de anestesia requerida en los procedimientos más rutinarios.

Tabla 1
(Dosis recomendadas de Lidocaína clorhidrato en adultos sanos normales)

Procedimiento	Conc. (%)	Vol. (ml)	Dosis total (mg)
Infiltración percutánea	1.0	1.60	5-300
Bloqueos nerviosos periféricos, por ej:			
Braquial	1.0	20 – 30	200 - 300
Intercostal / segmentos	1.0	3	30
Paravertebral	1.0	3 – 5	30 - 50
Pudendal (cada lado)		1.0	10 100
Bloqueos nerviosos simpáticos, por ej:			
Cervical (ganglio estrellado)	1.0	5	50
Lumbar	1.0	5 – 10	50 - 100
Bloqueo Nervioso central			
Epidural: Torácico		1.0	20 – 30 200 - 300
Lumbar, analgesia	1.0	25 – 30	250 - 300
Obstétrico: Parto vaginal	1.0	20 – 30	200 – 300
Cesárea		2.0	.15 .300
Caudal: Analgesia obstétrica	1.0	20 – 30	200 - 300
Analgesia quirúrgica	1.0	20 – 30	200 – 300
	2.0	10 – 15	200 – 300

Tabla 2
(Dosis recomendadas de Lidocaína clorhidrato con epinefrina 1:200.000 en adultos sanos normales)

Procedimiento	Conc. (%)	Vol. (ml)	Dosis total (mg)
Infiltración percutánea	1.0	1.60	5-300
Bloqueos nerviosos periféricos, por ej:			
Braquial	1.0	20 – 40	200 - 400
Intercostal / segmentos	1.0	3	30
Paravertebral	1.0	3 – 5	30 - 50
Pudendal (cada lado)	1.0	10	100
Bloqueos nerviosos simpáticos, por ej:			
Cervical (ganglio estrellado)	1.0	5	50
Lumbar, analgesia	1.0	5 – 10	50 – 100
Bloqueo Nervioso central			
Epidural: Torácico	1.0	20 – 30	200 - 300
Lumbar, analgesia	1.0	25 – 30	250 – 300
anestesia	2.0	10 – 20	200 - 400
Obstétrico:			
Parto vaginal	1.0	20 – 30	200 – 300
Cesárea	2.0	.20	.400
Caudal: Analgesia obstétrica	1.0	20 – 30	200 - 300
Analgesia quirúrgica	2.0	10 – 20	200 – 400

Antes de administrar la droga asegúrese del equipo de resucitación, tal como lo necesario para mantener una buena ventilación y oxigenación para el tratamiento de las reacciones tóxicas.

Contraindicaciones:
Alergia conocida a la lidocaína o a otros anestésicos locales de tipo amida.
Las soluciones de anestésicos locales que contienen epinefrina no deben ser administrados por vía intravenosa.

Un agregado de epinefrina está contraindicado en:

- La utilización en una región caracterizada por una irrigación terminal: dedos, dedo del pie, pene, extremidad de nariz, orejas.
- El glaucoma
- Las taquicardias paroxisticas. Los problemas del ritmo y de frecuencia elevada.
- Los estados de shock, en la miastemia.
- No se puede inyectar en zonas infectadas.

Medidas de precaución:
Conviene renunciar al uso de soluciones conteniendo epinefrina en los pacientes de edad avanzada y en los que padecen afecciones cardiovasculares, (hipertensión arterial, insuficiencia coronaria severa), en infarto de miocardio, taquicardia, hipertiroidismo y diabetes.
Elegir una posología y concentración lo más diluida posible.
Controlar la presión arterial en las intervenciones quirúrgicas de cierta importancia.
Debe tenerse en cuenta la posibilidad de hipotensión y bradicardia después del bloqueo nervioso central y deben tomarse las precauciones adecuadas.
Como los anestésicos locales se metabolizan por el hígado, dichas drogas en especial en dosis repetidas deben utilizarse con cautela en pacientes con insuficiencia hepática.
Los anestésicos locales deben utilizarse con cuidado para anestesia epidural en pacientes con trastornos en la función cardiovascular, ya que pueden ser menos capaces de compensar los cambios funcionales asociados con la prolongación de la conducción A-V producida por estas drogas.
Pequeñas dosis de anestésicos locales inyectados en la cabeza y el cuello, inclusive los bloqueos retrobulbares, dentales y del ganglio estrellado, pueden producir reacciones adversas similares a la toxicidad sistémica observadas con inyecciones intravasculares accidentales de dosis más altas.
Los profesionales que realicen bloqueos retrobulbares deben saber que se ha informado de paros respiratorios despu{es de la inyección del anestésico local. Antes de hacerlo, asegurar los equipos, drogas y personal necesario como con cualquier otro procedimiento regional.
El bloqueo paracervical, a diferencia de otros bloqueos obstétricos, puede afectar al feto en mayor medida. El ritmo cardíaco fetal siempre debe controlarse durante la anestesia paracervical ya que con frecuencia la bradicardia fetal sigue al bloqueo paracervical y puede asociarse con acidosis e hipoxia fetal. Debe considerarse la relación riesgo-ventaja del bloqueo paracervical cuando se sospecha sufrimiento fetal o cuando hay factores que predisponen al sufrimiento fetal (por ej. toxemia, diabetes, premadurez).

Embarazo y lactancia
Embarazo categoría C.
los estudios en animales han demostrado dentro de ciertas especies los efectos perjudiciales de la epinefrina en el feto (teratogenia).
Los estudios controlados en la especie humana no han permitido deducir las conclusiones definitivas. Dentro de ciertos casos conviene no utilizar Lidocaína – Epinefrina durante el embarazo y el alumbramiento, y sólo en aquellos casos en los que el beneficio potencial excede indiscutiblemente el riesgo fetal.
La epinefrina inhibe habitualmente las contracciones espontáneas o provocadas por la ocitocina en las mujeres embarazadas y retarda el segundo estadio del parto. A las dosis que inhiben estas contracciones, la epinefrina puede ocasionar una atonía uterina y hemorragias.
La utilización de anestésicos locales durante el nacimiento no comporta una seguridad de empleo absoluto en lo que concierne al niño a nacer.
No se dispone de pruebas concernientes a la lactancia.

Efectos indeseables:
Los anestésicos locales no producen en general efectos secundarios si no se sobrepasan las concentraciones y los volúmenes de soluciones recomendados. Una sobredosis relativa o absoluta se produce por ejemplo en una administración intravascular accidental, o una inyección en una zona bien irrigada o en los casos de inyecciones complementarias en las intervenciones de larga duración.
Síntomas:
Sistema nervioso central: Problemas en la visión o en la audición, nystagma, zumbido de oídos, vértigos, temblor, desorientación, pérdida de conciencia transitoria, elocución laboriosa, estremecimiento muscular, hipo, náuseas, vómitos.
Intoxicación: convulsiones tónico-clónicas, depresión respiratoria y circulatoria.
Otros síntomas tales como agitación, angustia, bradicardia, hiperpnea, elevación de la presión arterial, y cefaleas, pueden ser debidas al agregado de un vasoconstrictor como la epinefrina.
Sistema cardiovascular: efectos inótropos negativos, reducci{on de la velocidad de conducción, bradicardia sinusal, convulsiones, cianosis, pérdida de la conciencia, fibrilación ventricular, y/o asístole.
Una gangrena de miembros es posible después de una infiltración de Lidocaína – Epinefrina.

Interacciones:
Lidocaína:

1. Las de una utilización en anestesia local: potencialización recíproca con la epinefrina y la norepinefrina.
2. Por efecto sistémico de la lidocaína (la utilización con antiarrítmicos, en caso de sobredosaje, en caso de técnicas erróneas de inyección).

Epinefrina, norepinefrina
Potencializan los efectos cardíacos de la lidocaína.
Las asociaciones con otros antiarrítmicos activos sobre la fibrilación, con los betabloqueantes o los antagonistas del calcio. Conviene igualmente esperar después de la administración de la lidocaína una acción inhibitoria aditiva sobre la conducción aurículo ventricular, sobre la excitabilidad intraventricular y sobre la fuerza de contracción del miocardio.
Cimetidina: Retarda la eliminación y la elevación de la concentración sanguínea de lidocaína.
Propanolol: Retarda la degradación de la lidoca{ina.
Fenito{ina, benzodiacepinas, barbitúricos: Metabolismo acrecentado de la lidocaína.
Isoprenalina: Eliminación acrecentada de la lidocaína.
Suxametonium y otros curarizantes: Potenciación de efectos curarizantes por la lidocaína.

Otros antiarrítmicos: Acción aditiva después de la administración de lidocaína.

Epinefrina
El riesgo de problemas del ritmo cardíaco está acrecentado por una anestesia simultánea con ayuda de hidrocarburos halogenados. En particular una hipoxia.
Un tratamiento previo o simultáneo por la guanetidina mejora la sensibilidad de los receptores de la epinefrina.
Un aumento de los efectos puede producirse después de la administración de hormonas tiroideas, antihistamínicos y antidepresores tricíclicos. El tratamiento previo por inhibidores de la mono amino oxidasa no modifica la acción de la epinefrina de hecho mínima, porque la degradación metabólica por la catecol O – metil transferasa es predominante. Sin embargo se han igualmente descripto crisis hipertensivas graves.
La epinefrina puede producir una hiperglucemia. Es necesario aumentar la dosis de insulina o de hipoglucemiantes orales en los diabéticos.
Antidepresores tricíclicos. Mejoran los efectos simpaticomiméticos.

Sobredosis
Síntomas:
Ver efectos indeseables.
Tratamiento:
1. Suspensión inmediata de la inyección.
2. Garantizar una oxigenación (aspiración de vómitos, aspiración gástrica, mantener en libertad las vías aéreas, intubación, ventilación con ayuda de oxígeno).
3. Mantener el estado hemodinámico (administrar vasopresores, masaje cardíaco inmediato, por vía externa, después de una fibrilación ventricular o de una asístole).
4. Luchar contra las convulsiones (administrar dosis de un barbitúrico de acción rápida o de diazepam por vía intravenosa utilizar en los pacientes inconscientes, curarizantes de acción breve tal como la succinilcolina).

Centros de toxicología:
Hospital de pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247
Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/ 4658-7777

Presentaciones: (tanto para la Lidocaína clorhidrato 1 y 2 % como para la lidocaína clorhidrato 1 y 2 % con epinefrina)

10, 50, 100 ampollas de 5 ml, 10 ml y 10 ml
10 y 25 frascos ampolla de 20 ml

MANTENER ESTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud y Acción Social – ANMAT – Certificado Nº47120

Norgreen S.A.
Calle 2 entre 1 y 3 Parque Industrial Gral Savio Batan (7601) – Mar del Plata
Tel/Fx: 0223-4643170/2010/2170
E-mail: norgreen@norgreen.com
Director Técnico: Jorge Danilo Carrizo - Farmacéutico
Fecha de última revisión: 01/2010